

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
10. Februar 2005 (10.02.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/012302 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 473/00**,
A61K 31/52, A61P 31/12

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/008197

(22) Internationales Anmeldedatum:
22. Juli 2004 (22.07.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 35 061.6 31. Juli 2003 (31.07.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): **WACKER-CHEMIE GMBH** [DE/DE]; Hanns-Sei-
del-Platz 4, 81737 München (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **DÖRING, Wolfgang**
[DE/DE]; Angemannstrasse 11, 84561 Mehring (DE).
PETERSEN, Hermann [DE/DE]; Karl-Gros-Strasse 11,
84489 Burghausen (DE).

(74) Anwälte: **POTTEN, Holger** usw.; c/o Wacker-Chemie
GmbH, Hanns-Seidel-Platz 4, 81737 München (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT,
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: METHOD FOR THE PRODUCTION OF OH PROTECTED [4-(2,6-DIAMINO-9H-PURINE-9-YL)- 1,3-DIOX-
OLANE-2-YL]METHANOL DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON OH-GESCHÜTZTEN [4-(2,6-DIAMINO-9H-PURIN-9-YL)- 1,3-
DIOXOLAN-2-YL]METHANOL-DERIVATEN

(57) Abstract: The invention relates to a method for the production of OH protected [4-(2,6-diamino-9H-purine-9-yl)-1,3-diox-
olane-2-yl]methanol derivatives in a racemically or optically pure form by directly reacting 2,6-diaminopurine and/or a single or
multiple silylated 2,6-diaminopurine with a sugar component. An auxiliary agent in the form of a 1,3- dicarbonyl compound or a
silylated derivative of a 1,3 dicarbonyl compound is present during the reaction of the glycosylation, in addition to a Lewis acid.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von OH- geschützten [4-(2,6-diamino-9H-purin-9-
yl)-1,3-dioxolan-2-yl]methanol-Derivaten in racemischer oder optisch reiner Form durch direkte Umsetzung von 2,6-Diaminopu-
rin bzw. eines ein- oder mehrfach silylierten 2,6-Diaminopurins mit einem Zuckerbaustein, wobei bei der Glycosylierungsreaktion
neben einer Lewis-Säure ein Hilfsstoff in Form einer 1,3- Dicarbonylverbindung oder eines silylierten Derivates einer 1,3-Dicarbo-
nylverbindung zugegen ist.

WO 2005/012302 A1